

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problems Mailbox.**

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

**Topical sterol formulation for use as deodorant - contains e.g. cholesterol, lanosterol, cholesteryl oleate or sulphate used to combat microorganisms, viruses, parasites and protozoa**

**Patent Number : DE19643586**

*International patents classification : A61K-007/40 A61K-007/027 A61K-007/075 A61K-007/08 A61K-007/11 A61K-007/15 A61K-007/32 A61K-007/48 A61K-031/56*

• **Abstract :**

DE19643586 A Formulation containing at least one sterol or sterol derivative and its use to combat microorganisms, viruses, parasites and protozoa.  
USE - Use of the formulation is for topical application as a deodorant.

ADVANTAGE - The formulation is an effective deodorant which does not irritate the skin on excessive or repeated exposure, and may be used in combination with the usual cosmetic substances. (Dwg.0/0)

• **Publication data :**

Patent Family : DE19643586 A1 19980423 DW1998-23 A61K-007/40 20p \* AP: 1996DE-1043586 19961022

Priority n° : 1996DE-1043586 19961022

Covered countries : 1

Publications count : 1

• **Patentee & Inventor(s) :**

Patent assignee : (BEIE ) BEIERSDORF AG

Inventor(s) : TRAUPE B; WOLF F

• **Accession codes :**

Accession N° : 1998-251941 [23]

Sec. Acc. n° CPI : C1998-078576

• **Derwent codes :**

Manual code : CPI: B01-D01 B01-D02  
B14-A01 B14-A02 B14-A03 B14-B02 B01-D01 C01-D01 B01-D02 C01-D02 B14-A01  
C14-A01 B14-A02 C14-A02 B14-A03 C14-A03 B14-B02 C14-B02 C01-D01 C01-D02  
C14-A01 C14-A02 C14-A03 C14-B02 D09-A01C D09-A02 D09-B E01  
Derwent Classes : B01 C03 D22 E15

• **Update codes :**

Basic update code : 1998-23

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

(19) BUNDESREPUBLIK

DEUTSCHLAND



DEUTSCHES

PATENTAMT

(12) **Offenlegungsschrift**  
(10) **DE 196 43 586 A 1**

(51) Int. Cl. 6:

**A 61 K 7/40**

A 61 K 7/48

A 61 K 7/32

A 61 K 7/027

A 61 K 7/075

A 61 K 7/08

A 61 K 7/11

A 61 K 7/15

A 61 K 31/56

- (21) Aktenzeichen: 196 43 586.2  
(22) Anmeldetag: 22. 10. 96  
(43) Offenlegungstag: 23. 4. 98

(71) Anmelder:

Beiersdorf AG, 20253 Hamburg, DE

(72) Erfinder:

Wolf, Florian, Dr., 20251 Hamburg, DE; Traupe,  
Bernd, 22457 Hamburg, DE

(56) Für die Beurteilung der Patentfähigkeit in Betracht  
zu ziehende Druckschriften:

DE 43 28 828 A1  
DE 41 30 915 A1  
DE 33 20 304 A1  
DE 28 41 346 A1  
US 55 49 901  
US 50 79 239  
US 39 31 403  
EP 06 65 238 A1  
EP 05 87 374 A2  
EP 05 54 897 A2  
EP 04 39 042 A1  
WO 95 31 966 A1

BÜECHI, Samuel: Antivirale Saponine. In:  
Deutsche Apotheker Zeitung, 136.Jg., Nr.2,  
11.1.1996, S.19-26,28;  
WACHTER,R., u.a.: Phytosterole - pflanzliche  
Wirkstoffe in der Kosmetik. In: Parfümerie  
und Kosmetik, 75.Jg., Nr.11/94, S.755-758,761;  
Chemical Abstracts:  
Vol.124, 1996, Ref. 352434y;  
Vol.124, 1996, Ref. 25505k;  
Vol.119, 1993, Ref. 4933e;  
Vol.113, 1990, Ref. 148855e;  
Vol.109, 1988, Ref. 115922p;  
Vol. 99, 1983, Ref. 10844m;  
Vol. 76, 1972, Ref. 355p;  
Vol.107, 1987, Ref. 46050x;  
Derwent Abstracts:  
Ref. 90-189695/25 zu JP 02124-826-A;  
Ref. 93-131189/16 zu JP 05070-323-A;

**Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen**

(54) Gegen Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen wirksame Sterole und Sterolderivate

(57) Verwendung einer Verbindung oder mehrerer Verbindungen aus der Gruppe der Sterole und Sterolderivate als antimikrobielle, antivirale, antiparasitäre und gegenüber Protozoen antiparasitäre Wirkstoffe gegenüber Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen.

## Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung einiger bekannter Substanzen als gegen Bakterien, Mycota, Protozoen und Viren, d. h. also gegen Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen wirksame Substanzen. In besonderen Ausführungsformen betrifft die vorliegende Erfindung kosmetische und dermatologische Zubereitungen, solche Substanzen enthaltend.

Der gesunde warmblütige Organismus, insbesondere die gesunde menschliche Haut, ist mit einer Vielzahl nichtpathogener Mikroorganismen besiedelt. Diese sogenannte Mikroflora der Haut ist nicht nur unschädlich, sie stellt einen wichtigen Schutz zur Abwehr opportunistischer oder pathogener Keime dar.

Bakterien gehören zu den prokaryotischen Einzellern. Sie können grob nach ihrer Form (Kugel, Zylinder, gekrümmter Zylinder) sowie nach dem Aufbau ihrer Zellwand (grampositiv, grammnegativ) unterschieden werden. Feinere Unterteilungen tragen auch der Physiologie der Organismen Rechnung. So existieren aerobe, anaerobe sowie fakultativ anaerobe Bakterien. Manche Organismen sind in ihrer Eigenschaft als pathogene Keime von medizinischer Bedeutung, andere wiederum sind vollkommen unschädlich.

Gegen Bakterien wirksame Substanzen sind seit geraumer Zeit bekannt. Der Begriff "Antibiotika" beispielsweise, der nicht auf alle antimikrobiell wirksamen Substanzen anwendbar ist, läßt sich auf das Jahr 1941 datieren, obwohl die ersten Erkenntnisse zum Penicillin bereits im Jahre 1929 gefunden wurden. Antibiotikain heutigen Sinne sind nicht für alle medizinischen, schon gar nicht kosmetische Anwendungen geeignet, da häufig auch der warmblütige Organismus, also etwa der erkrankte Patient, bei Anwendung auf irgendeine Weise in seinen Stoffwechselzirkulationen beeinträchtigt wird.

Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung war also, den Stand der Technik in dieser Richtung zu bereichern, insbesondere also, Substanzen zur Verfügung zu stellen, welche gegen grampositive und/oder grammnegative Bakterien wirksam sind, ohne daß mit der Anwendung der Substanzen eine unvertretbare Beeinträchtigung der Gesundheit des Anwenders verbunden wäre.

Gramnegative Keime sind beispielsweise Escherichia coli, Pseudomonas-Arten sowie Enterobacteriaceen, wie etwa Citrobacter.

Auch grampositive Keime spielen in Kosmetik und Dermatologie eine Rolle. Bei der unreinen Haut beispielsweise sind neben anderen Einflüssen bakterielle Sekundärinfektionen von ätiologischer Bedeutung. Einer der wichtigsten Mikroorganismen, der in Zusammenhang mit unreiner Haut steht, ist das Propionibacterium acnes.

Unreine Haut und/oder Komedonen beeinträchtigen das Wohlbefinden der Betroffenen aber selbst in leichten Fällen. Da praktisch jeder oder jede Jugendliche von unreiner Haut irgendeiner Ausprägung betroffen ist, besteht bei vielen Personen Bedarf, diesem Zustande abzuholen.

Eine besondere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es also, einen gegen unreine Haut bzw. Propionibacterium acnes wirksamen Wirkstoff zu finden.

Die vorliegende Erfindung betrifft in einer weiteren Ausführungsform kosmetische Desodorantien. Solche Formulierungen dienen dazu, Körpergeruch zu beseitigen, der entsteht, wenn der an sich geruchlose frische Schweiß durch insbesondere grampositive Mikroorganismen zerstört wird. Den üblichen kosmetischen Desodorantien liegen unterschiedliche Wirkprinzipien zugrunde.

Bekannt und gebräuchlich sind sowohl flüssige Desodorantien, beispielsweise Aerosolsprays, Roll-ons und dergleichen als auch feste Zubereitungen, beispielsweise Deo-Stifte ("Sticks"). Puder. Pudersprays. Intimreinigungsmittel usw.

In sogenannten Antitranspirantien kann durch Adstringentien – vorwiegend Aluminiumsalze wie Aluminiumhydroxychlorid (Aluchlorhydrat) – die Entstehung des Schweißes unterbunden werden. Abgesehen von der Denaturierung der Hautproteine greifen die dafür verwendeten Stoffe aber, abhängig von ihrer Dosierung, drastisch in den Wärmehaushalt der Achselregion ein und sollten allenfalls in Ausnahmefällen angewandt werden.

Durch die Verwendung antimikrobieller Stoffe in kosmetischen Desodorantien kann die Bakterienflora auf der Haut reduziert werden. Dabei sollten im Idealfalle nur die Geruch verursachenden Mikroorganismen wirksam reduziert werden. In der Praxis hat sich aber herausgestellt, daß die gesamte Mikroflora der Haut beeinträchtigt werden kann.

Der Schweißfluß selbst wird dadurch nicht beeinflußt, im Idealfalle wird nur die mikrobielle Zersetzung des Schweißes zeitweilig gestoppt.

Auch die Kombination von Adstringentien mit antimikrobiell wirksamen Stoffen in ein und derselben Zusammensetzung ist gebräuchlich. Die Nachteile beider Wirkstoffklassen lassen sich auf diesem Wege jedoch nicht vollständig beseitigen.

Schließlich kann Körpergeruch auch durch Duftstoffe überdeckt werden, eine Methode, die am wenigsten den ästhetischen Bedürfnissen des Verbrauchers gerecht wird, da die Mischung aus Körpergeruch und Parfümduft eher unangenehm riecht.

Allerdings werden die meisten kosmetischen Desodorantien, wie auch die meisten Kosmetika insgesamt, parfümiert, selbst wenn sie desodorierende Wirkstoffe beinhalten. Parfümierung kann auch dazu dienen, die Verbraucherakzeptanz eines kosmetischen Produktes zu erhöhen oder einem Produkt ein bestimmtes Flair zu geben.

Die Parfümierung wirkstoffhaltiger kosmetischer Mittel, insbesondere kosmetischer Desodorantien, ist allerdings nicht selten problematisch, weil Wirkstoffe und Parfümbestandteile gelegentlich miteinander reagieren und einander unwirksam machen können.

Desodorantien sollen folgende Bedingungen erfüllen:

- 1) Sie sollen eine zuverlässige Desodorierung bewirken.
- 2) Die natürlichen biologischen Vorgänge der Haut dürfen nicht durch die Desodorantien beeinträchtigt werden.
- 3) Die Desodorantien müssen bei Überdosierung oder sonstiger nicht bestimmungsgemäßer Anwendung unschädlich sein.
- 4) Sie sollen sich nach wiederholter Anwendung nicht auf der Haut anreichern.
- 5) Sie sollen sich gut in übliche kosmetische Formulierungen einarbeiten lassen.

Eine weitere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es also, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, die die Nachteile des Standes der Technik nicht aufweisen. Insbesondere sollten die Desodorantien die Mikroflora der Haut weitgehend schonen, die Zahl der Mikroorganismen aber, die für den Körpergeruch verantwortlich sind, selektiv reduzieren.

Weiterhin war es eine Aufgabe der Erfindung, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, die sich durch gute Hautverträglichkeit auszeichnen. Auf keinen Fall sollten die desodorierenden Wirkprinzipien sich auf der Haut anreichern.

Eine weitere Aufgabe war, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, welche mit einer möglichst großen Vielzahl an üblichen kosmetischen Hilfs- und Zusatzstoffen harmonieren, insbesondere mit den gerade in desodorierend oder anti-transpirierend wirkenden Formulierungen bedeutenden Parfümbestandteilen.

Noch eine weitere Aufgabe der Erfindung war, kosmetische Desodorantien zur Verfügung zu stellen, welche über einen längeren Zeitraum, und zwar in der Größenordnung von mindestens einem halben Tag, wirksam sind, ohne daß ihre Wirkung spürbar nachläßt.

Schließlich war eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung, desodorierende kosmetische Prinzipien zu entwickeln, die möglichst universell in die verschiedensten Darreichungsformen kosmetischer Desodorantien eingearbeitet werden können, ohne auf eine oder wenige spezielle Darreichungsformen festgelegt zu sein.

Pilze, auch Fungi [fungus = lat. Pilz], Mycota [ $\mu\kappa\eta\zeta$  = grch. Pilz] oder Mycobionten genannt, zählen im Gegensatz zu den Bakterien zu den Eucaryonten. Eucaryonten sind Lebewesen, deren Zellen (Eucyten) im Gegensatz zu denen der sogenannten Prokaryonten (Procyten) über einen durch eine Kernmembran vom restlichen Cytoplasma abgegrenzten Zellkern verfügen. Der Zellkern enthält die Erbinformation in Chromosomen gespeichert.

Zu Vertretern der Mycobionten zählen beispielsweise Hefen (Protoascomycetes), Schimmelpilze (Plectomycetes), Mehltau (Pyrenomycetes), der falsche Mehltau (Phycomycetes) und die Ständerpilze (Basidiomycetes).

Pilze, auch nicht die Basidiomyceten, sind keine pflanzlichen Organismen, haben aber wie diese eine Zellwand, zell-saftgefüllte Vakuolen und eine mikroskopisch gut sichtbare Plasmastörung. Sie enthalten keine photosynthetischen Pigmente und sind kohlenstoff-heterotroph. Sie wachsen unter aeroben Bedingungen und gewinnen Energie durch Oxidation organischer Substanzen. Einige Vertreter, beispielsweise Hefen, sind allerdings fakultative Anaerobier und zur Energiegewinnung durch Gärungsprozesse befähigt.

Dermatomycosen sind Krankheiten, bei der gewisse Pilzarten, insbesondere Dermatophyten, in die Haut und Haarfolikel eindringen. Die Symptome von Dermatomycosen sind beispielsweise Bläschen, Exfoliation, Rhagaden und Erosion, meist verbunden mit Juckreiz oder allergischem Ekzem.

Dermatomycosen können im wesentlichen in folgende vier Gruppen unterteilt werden: Dermatophyten (z. B. Epidermophytie, Favus, Mikrosporie, Trichophytie), Hefemycosen (z. B. Pityriasis und andere Pityrosporum-bedingte Mycosen, Candida-Infektionen, Blastomycose, Busse-Buschke-Krankheit, Torulose, Piedra alba, Torulopsidose, Trichosporosen (z. B. Chromiomycose, Coccidiomycose, Histoplasmosis)).

Zu den pathogenen und fakultativ pathogenen Keimen gehören beispielsweise aus der Gruppe der Hefen Candida-Arten (z. B. Candida albicans) und solche der Familie Pityrosporum. Pityrosporum-Arten, insbesondere Pityrosporum ovale, sind für Hauterkrankungen wie Pityriasis versicolor, Seborrhoe in den Formen Seborrhoea oleosa und Seborrhoea sicca, welche sich vor allem als Seborrhoea capitis (= Kopfschuppen) äußern, seborrhoisches Ekzem und Pityrosporum-Follikulitis verantwortlich zu machen. Eine Beteiligung von Pityrosporum ovale an der Entstehung von Psoriasis wird von der Fachwelt diskutiert.

Alle Bereiche der menschlichen Haut können von Dermatomycosen befallen werden. Dermatophyten befallen fast ausschließlich Haut, Haare und Nägel. Hefemycosen können auch Schleimhäute und innere Organe befallen. Systemmycosen erstrecken sich regelmäßig auf ganze Organsysteme.

Besonders häufig sind die Körperfälle betroffen, auf welchen sich durch Kleidung, Schmuck oder Schuhwerk Feuchtigkeit und Wärme stauen können. So gehört der Fußpilz zu den bekanntesten und am weitesten verbreiteten Dermatomycosen. Besonders unangenehm sind weiterhin Pilzerkrankungen der Finger- und Fußnägelbereiche (Onychomykosen).

Ferner sind Superinfektionen der Haut durch Pilze und Bakterien nicht selten.

Bei bestehendem Primärinfekt, d. h. der normalen Keimbeseidlung der Haut, eintretender Neuinfektion mit hohen Keimzahlen eines oder mehrerer oft physiologischer Erreger, beispielsweise Staphylokokken, oft aber auch unphysiologischer Erreger, beispielsweise Candida albicans, kann bei Zusammentreffen ungünstiger Einflüsse eine "Superinfektion" der befallenen Haut auftreten. Die normale Mikroflora der Haut (oder eines anderen Körperorgans) wird dabei von dem Sekundärerreger regelrecht überwuchert.

Solche Superinfektionen können sich, in Abhängigkeit vom betreffenden Keim, in günstig verlaufenden Fällen in unangenehmen Hauterscheinungen (Juckreiz, unschönes äußeres Erscheinungsbild) äußern. In ungünstig verlaufenden Fällen können sie aber zu großflächiger Zerstörung der Haut führen, im schlimmsten Falle sogar im Tode des Patienten gipfeln.

Superinfektionen der vorab geschilderten Art sind z. B. beim Vollbild von AIDS häufig auftretende Sekundärerkrankungen. An sich – jedenfalls in geringen Keimdichten – unschädliche, aber unter Umständen auch ausgesprochen pathogene Keime überwuchern auf diese Weise die gesunde Hautflora. Bei AIDS allerdings sind auch andere Körperorgane von Superinfektionen betroffen.

Ebenso werden derartige Superinfektionen bei einer Vielzahl dermatologischer Erkrankungen, z. B. atopischem Ekzem, Neurodermitis, Akne, seborrhoischer Dermatitis oder Psoriasis beobachtet. Auch viele medizinische und therapeutische Maßnahmen, z. B. die Radio- oder Chemotherapie von Tumorerkrankungen, als Nebenwirkung hervorgerufene, medikamentös induzierte Immunsuppression oder aber systemische Antibiotikabehandlung, ebenso wie externe chemische oder physikalische Einflüsse (z. B. Umweltverschmutzung, Smog), fördern das Auftreten von Superinfektionen der äußeren und inneren Organe, insbesondere der Haut und der Schleimhäute.

Zwar ist es im Einzelfalle ohne weiteres möglich, Superinfektionen mit Antibiotika zu bekämpfen, meistens haben solche Substanzen aber den Nachteil unangenehmer Nebenwirkungen. Oft sind Patienten beispielsweise gegen Penicilline allergisch, weswegen eine entsprechende Behandlung sich in einem solchen Falle verbieten würde.

5 Ferner haben topisch verabreichte Antibiotika den Nachteil, daß sie die Hautflora nicht nur vom Sekundärerreger befreien, sondern auch die an sich physiologische Hautflora stark beeinträchtigen und der natürliche Heilungsprozeß auf diese Weise wieder gebremst wird.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung war, die Nachteile des Standes der Technik zu beseitigen und Substanzen und Zubereitungen, solche Substanzen enthaltend, zur Verfügung zu stellen, durch deren Verwendung Superinfektionen geheilt werden können, wobei die physiologische Hautflora keine nennenswerte Einbußen erleidet.

10 Protozoen sind parasitisch lebende Einzeller mit klar abgegrenztem Zellkern, die sich ungeschlechtlich fortpflanzen (durch Teilung sowie Knospung), oder aber geschlechtlich (Gameto-, Gamonto- und Autogamie). Die Nahrungsaufnahme aus der Umgebung erfolgt durch Permeation sowie durch Pino- oder Phagozytose. Die meisten Protozoen können neben vegetativen, meist beweglichen Zustandsformen (sogenannten Trophozooten) unter ungünstigen Umständen auch Zysten als Dauerformen ausbilden.

15 Je nach Fortbewegungsart und -apparat werden Protozoen in vier verschiedene Gruppen unterteilt:

- (a) Mastigophora (Flagellaten mit Geißeln)
- (b) Sarcodina/Rhizopoda (amöboides Bewegungsmuster durch Plasmaausschlüpfungen)
- (c) Sporozoa (schlängelndes oder gleitendes Bewegungsmuster)
- (d) Ciliata/Ciliophora (Bewimpelung oder Begeißelung).

Parasitisch lebende Protozoen werden in subtropischen und tropischen Gebieten häufig durch stechende und saugende Insekten, aber auch Schmutz- und Schmierinfektion sowie durch die Nahrungskette übertragen.

Einige medizinisch und dermatologisch relevante Protozoenosen sind: Trichomoniasis (verursacht von Trichomonas vaginalis), Lamblienruhr (verursacht durch *Lamblia intestinalis*), viszerale sowie kutane und Schleimhaut-Leishmaniose (verursacht beispielsweise durch *Leishmania donovani*, *L.tropica*, *L.brasiliensis*, *L.mexicana*, *L.diffusa* oder *L.pifanoi*), Trypanosomiasis (verursacht durch verschiedene Trypanosoma-Arten), Amöbenruhr und Amöbiasis (verursacht beispielsweise durch verschiedene Entamoeba-Arten, *Jodamoeba butschlii* oder *Naegleria fowleri*), Kokzidiose (durch *Iospora belli*) und Balantidenruhr (verursacht durch *Balantidium coli*).

20 Durch Protozoenosen hervorgerufene medizinische und dermatologische Phänomene beeinträchtigen, zum Teil erheblich, das menschliche Wohlbefinden. Es besteht daher bei den betroffenen Personen ein erheblicher Bedarf, diesem Zustand abzuholen. Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es also, gegen Protozoen wirksame Wirkprinzipien zu finden.

Parasiten sind ein- oder mehrzellige Pflanzen oder Tiere, die sich auf (= Ektoparasiten) oder in (= Endoparasiten) anderer Lebewesen auf deren Kosten ernähren, und zwar mit (= Pathogene Parasiten) oder ohne (Apathogene Parasiten) Verursachung von Krankheitserscheinungen. Die Lebensweise ist entweder auch aphytisch oder aber rein parasitär, eventuell nur als periodischer, temporärer oder stationärer Parasit. Die Entwicklung von Parasiten ist an einen oder mehrere verschiedene Wirtsorganismen gebunden, wobei der Mensch Zwischenwirt oder Endwirt sein kann.

Medizinisch und dermatologisch bedeutsame Parasiten sind beispielsweise die Helminthen, die sich wiederum in Trematoda, Cestoda und Nematodae untergliedern. Das menschliche Wohlbefinden beeinträchtigende Helminthosen sind beispielsweise Bilharziose, (verursacht durch Schistosoma-Arten), Bandwurmbefall vom Darm und anderen inneren Organen (verursacht durch beispielsweise Taenia-Arten und Echinococcus-Arten), Ascariasis (verursacht durch *Ascaris lunubricoides*), Enterobiasis (verursacht durch *Enterobius vermicularis*), Paragonimiasis (verursacht durch Paragonium-Arten), Filariose (verursacht beispielsweise durch *Wuchereria bancrofti*) sowie anderer Nematodenbefall (beispielsweise verursacht durch *Trichuris trichura* oder *Trichinella spiralis*).

Darüberhinaus bestehen eine Vielzahl auf bzw. in Mensch und Tier parasitisch lebender Insektenarten bzw. Spinnentieren, die medizinische und dermatologische Veränderungen der Wirtsorganismen hervorrufen. In dieser Hinsicht für die Beeinträchtigung des menschlichen Wohlbefindens verantwortliche Parasiten sind beispielsweise Accrodermatitis (verursacht durch Getreidemilben, beispielsweise *Pediculoides ventricosus*), Skabies (verursacht durch *Sarcoptes scabiei*), Fliegen- und/oder Fliegenlarvenbefall (verursacht beispielsweise durch *Glossina-Stomoxys*-, *Tabanus*-, *Chrysops*-, *Lucilia*-, *Chrysomya*-, *Cochliomyia*-, *Wohlfartia*-, *Cordylobia*- oder *Dermatobia*-Arten), Mücken- und/oder Mückenlarvenbefall (verursacht beispielsweise durch *Aedes-Culex*-, *Anopheles*-, *Phlebotomus-Culicoides*-, *Sumilium*- oder *Haemagoges*-Arten), Zeckenbefall (verursacht beispielsweise durch *Argas persicus* und andere *Argas*-Arten, *Ornithodoros erraticus* und andere *Ornithodoros*-Arten, *Orobis-Rhiphocephalus*-, *Dermacentor*-, *Haemaphysalis*-, *Amblyomma*-, *Ixodes*-Arten), Porocephalose (verursacht durch *Porocephalus*-Arten), Flohbefall (verursacht durch beispielsweise *Pulex irritans*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopsis*, *Nosophyllus fasciatus* oder *Sarcopsylla penetrans*), Läusebefall (verursacht beispielsweise durch *Phthirus pubis*, *Pediculus humanus* oder *Pediculususcapitis*), Wanzenbefall (verursacht beispielsweise durch *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Panstrongylus megistus*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma dimidiata*, *Triatoma infestans*, *Triatoma sordida* oder *Triatoma brasiliensis*) sowie Milbenbefall (verursacht beispielsweise durch *Demodexfolliculorum* und andere *Demodex*-Arten sowie durch *Dermatophagoides*-, *Glyciphagus domesticus*, *Pyemotes*-Arten, *Sarcoptes*-Arten oder *Trombicula*-Arten).

60 Dabei ist von zusätzlicher Bedeutung, daß die auf oder im menschlichen Organismus lebenden Parasiten ihrerseits wieder Überträger von Bakterien, Mykota, Protozoen und Viren sein können, die Gesundheit und Wohlbefinden des Wirtsorganismus, beispielsweise des Menschen, nachhaltig beeinträchtigen können. Es bestand daher der Bedarf, gegen Parasiten wirksame Wirkprinzipien zu finden, welche das medizinische oder dermatologische Erscheinungsbild zu verbessern imstande sind. Diesen Bedarf zu stillen, war daher eine weitere Aufgabe der vorliegenden Erfindung.

65 Im Gegensatz zu den prokaryotischen und eukaryotischen zellulären Organismen sind Viren [virus = lat. Gift] biologische Strukturen, welche zur Biosynthese eine Wirtszelle benötigen. Extrazelluläre Viren (auch "Virionen" genannt) be-

stehen aus einer ein- oder doppelsträngigen Nukleinsäuresequenz (DNS oder RNS) und einem Proteinmantel (Capsid genannt), gegebenenfalls einer zusätzlichen lipidhaltigen Hülle (Envelope) umgeben. Die Gesamtheit aus Nukleinsäure und Capsid wird auch Nucleocapsid genannt. Die Klassifikation der Viren erfolgte klassisch nach klinischen Kriterien, heutzutage allerdings zumeist nach ihrer Struktur, ihrer Morphologie, insbesondere aber nach der Nukleinsäuresequenz.

Medizinisch wichtige Virengattungen sind beispielsweise Influenzaviren (Familie der Orthomyxoviridae), Lyssaviren (z. B. Tollwut, Familie der Rhabdoviren) Enteroviren (z. B. Hepatitis-A, Familie der Picornaviridae), Hepadnaviren (z. B. Hepatitis-B, Familie der Hepadnaviridae).

Viruzide, also Viren abtötende Substanzen im eigentlichen Sinne gibt es nicht, da Viren nicht über einen eigenen Stoffwechsel verfügen. Es wurde aus diesem Grunde auch diskutiert, ob Viren als Lebewesen eingeordnet werden sollten. Pharmakologische Eingriffe ohne Schädigung der nicht befallenen Zellen sind jedenfalls schwierig. Mögliche Wirkmechanismen im Kampf gegen die Viren sind in erster Linie die Störung deren Replikation, z. B. durch Blockieren der für die Replikation wichtigen Enzyme, die in der Wirtszelle vorliegen. Ferner kann das Freisetzen der viralen Nukleinsäuren in die Wirtszelle verhindert werden. Im Rahmen der hiermit vorgelegten Offenbarung wird unter Begriffen wie "antiviral" oder "gegen Viren wirksam", "viruzid" oder ähnlichen, die Eigenschaft einer Substanz verstanden, einen ein- oder mehrzelligen Organismus vor schädlichen Folgen einer Virusinfektion, sei es prophylaktisch oder therapeutisch, zu schützen, ungeachtet dessen, was der tatsächliche Wirkmechanismus der Substanz im Einzelfalle sei.

Dem Stande der Technik mangelt es jedoch an gegen Viren wirksamen Substanzen, welche zudem den Wirtsorganismus nicht oder nicht in vertretbarem Maße schädigen.

Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung war also, diesen Nachteilen abzuholen, also Substanzen zu finden, welche wirksam einen ein- oder mehrzelligen Organismus vor schädlichen Folgen einer Virusinfektion, sei es prophylaktisch oder therapeutisch, schützen.

Gegenstand der Erfindung ist die Verwendung einer Verbindung oder mehrerer Verbindungen aus der Gruppe der Sterole und Sterolderivate als antimikrobielle, antivirale, antiparasitäre und gegenüber Protozoen antiparasitäre Wirkstoffe gegenüber Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen.

Gegenstand der Erfindung ist auch, die Verwendung einer Verbindung oder mehrerer Verbindungen aus der Gruppe der Sterole und Sterolderivate als antimikrobielle, antivirale, antiparasitäre und gegenüber Protozoen antiparasitäre Wirkstoffe gegenüber Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen als Bestandteil von Zubereitungen.

Gegenstand der Erfindung sind auch Zubereitungen mit einem Gehalt von einer Verbindung oder mehreren Verbindungen aus der Gruppe der Sterole und Sterolderivate mit antimikrobieller, antiviraler, antiparasitärer und gegenüber Protozoen antiparasitärer Wirkung gegenüber Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe und Zubereitungen können prophylaktisch verwendet werden und bewirken, daß sich nur noch geringen und keine störenden Ansammlungen von Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen ausbilden, oder sie beseitigen auch bereits vorhandene Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen und verringern so deren Anzahl.

Die genannten Aufgaben werden erfindungsgemäß gelöst. Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe haben die erfindungsgemäßen, genannten Wirkungen auf Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen und sind zur Behandlung der genannten Störungen und Krankheiten geeignet.

Geeignete Sterole und Sterolderivate sind beispielsweise:

- A) natürliche, natur-identische und synthetisch zugängliche Sterole
- B) natürliche und synthetische Steroidhormone mit einer Sterol-Struktur, und

C) Naturstoffe und Naturstoffgemische, die Verbindungen mit einer Sterol-Struktur enthalten.

Gut geeignete Sterole (auch als "Sterine" bezeichnet) A) sind z. B. Zoosterole, Phytosterole und Mykosterole.

Bevorzugte Zoosterole sind Cholesterol, Dihydrocholesterol, 7-Dehydrocholesterol, Lanosterol, Dihydrolanosterol, Spongosterol und Stellasterol.

Bevorzugte Phytosterole sind Ergosterol, Sitosterol, Stigmasterol, Fucosterol, Brassicasterol und Campesterol. Bevorzugte Mykosterole sind Ergosterol, Fungisterol und Zymosterol.

Bevorzugte Verbindungen sind insbesondere Cholsterol, 7-Dehydrocholesterol, Dihydrocholesterol, Lanosterol, Dihydrolanosterol, Spongosterol, Koprosterol, Phytosterole, Cholestryloleat und Cholesterylulfat.

Gut geeignet sind weiterhin Cholecalciferol, Ergocalciferol und Calciferol.

Geeignete Steroidhormone B) sind beispielsweise Androgene, Östrogene, Gestagene, Corticoide, Mineralcorticoide und Ecdyson.

Bevorzugte Naturstoffe und Naturstoffgemische C) sind Wollwachs und Wollwachsalkohole, Sojasterole, Tallölsterole und Naturstoffe mit Steroidgerüsten, beispielsweise:

- Cardenolide (z. B. Digoxygenin, Digitoxin, Digoxin, Gitoxin, Gitoxygenin, Digitoxigenin),
- Bufadienolide (z. B. Scillarenin, Scillaren),
- Steroid-Saponagine (z. B. Digitogenin, Gitogenin, Tigogenin),
- Gallensäuren und deren Derivate (z. B. Cholsäure, Glykocholsäure, Taurocholsäure, Desoxycholsäure, Lithocholsäure, Chenodesoxycholsäure, Cholansäure), und
- Steroid-Alkaloide (z. B. Solanidin, Tomatidin, Strophantin, Conessin).

55

60

65

Gegenstand der Erfindung sind auch die hydrierten Derivate der Sterole der Gruppen A, B und C, insbesondere der Gruppe A.

Sie können z. B. in der 5/6-Stellung, 7/8-Stellung und/oder 8/9-Stellung hydriert sein.

Bevorzugt werden die Dihydroderivate, insbesondere die 5/6-Dihydroderivate.

Weiterhin sind auch die Dehydroderivate der Sterole der Gruppen A, B und C geeignet, insbesondere die 7-Dehydroderivate.

Bevorzugt werden Dihydrocholesterol, Dihydrolanosterol und 7-Dehydrocholesterol.

Geeignete Derivate der Verbindungen der Gruppen A, B und C, die auch in den hydrierten Formen, insbesondere Hydroformien, oder den Dehydroformien vorliegen können, sind auch solche Derivate, die durch Substitution der 3-Hydroxygruppe der Sterole erhältlich sind und im folgenden auch mit D bezeichnet werden. Bevorzugt werden diese Derivate von Verbindungen der Gruppe A.

5 Bevorzugt werden diese 3-OH-Gruppen mit anorganischen oder organischen Säuren oder mit Alkoholen umgesetzt, also verestert oder verethert, oder aber mit Aminen umgesetzt, wobei sich durch Ersatz der Sterol-3-OH-Gruppe eine substituierte 3-Amino-Gruppe des Sterol-Grundgerüstes ergibt.

- 10 a) Die Sterol-3-OH-Gruppe kann beispielsweise mit anorganischen Säuren wie Schwefelsäure oder Phosphorsäure verestert werden. Bevorzugt werden die Sulfate, insbesondere die Sulfate der Verbindungen der Gruppe A, z. B. Cholesteryl-3-sulfat.
- 15 b) Die 3-OH-Gruppe kann mit Carbonsäuren verestert sein. Geeignet sind z. B. verzweigte oder unverzweigte, gesättigte oder ungesättigte, vorzugsweise ein- bis 5fach, insbesondere ein- oder zweifach ungesättigte Carbonsäuren mit 1-40, vorzugsweise 1-20 Kohlenstoffatomen. Bevorzugt werden Cholesterylformiat, Cholesterylisostearat, Cholestryloleat und beta-Sitosterylacetat. Besonders bevorzugt werden die genannten Carbonsäureester des Sojasteroles, insbesondere Sojasterolacetat. Weiterhin werden die genannten Carbonsäureester der Phytosterole und Dihydrophytosterole bevorzugt, insbesondere die Octadecanoate, z. B. Dihydrophytosteryloctadecanoat.
- 20 c) Die 3-OH-Gruppe kann auch mit hydroxylierten Carbonsäuren verestert sein. Geeignet sind z. B. ein- bis fünf-fach hydroxylierte Carbonsäuren, z. B. wie unter b) beschrieben. Mono- und Dihydroxycarbonsäuren werden bevorzugt. Bevorzugt werden Cholesterylhydroxystearate, vorzugsweise die Monohydroxystearate, vorzugsweise Cholesteryl- $\alpha$ -hydroxystearat.
- 25 d) Die 3-OH-Gruppe kann auch mit Alkoholen verethert vorliegen. Geeignet sind z. B. geradkettige oder verzweigte, gesättigte oder ein- bis fünf-fach, vorzugsweise ein- oder zweifach ungesättigte Monoalkohole mit 1-40, insbesondere 1-20 Kohlenstoffatomen.
- 30 e) Die 3-OH-Gruppe kann auch mit Polyolen verethert sein. Geeignet sind geradkettige oder verzweigte, gesättigte oder ein- bis fünf-fach, vorzugsweise ein- oder zweifach ungesättigte Polyhydroxyalkanole mit 2-8, vorzugsweise 2-6, insbesondere 2 oder 3 Hydroxygruppen. Bevorzugt werden Glyceryllanolat und die mit Sorbit, Mannit oder Xylit erhältlichen Sterolether, insbesondere die des Cholesterols.
- 35 f) Die 3-OH-Gruppe kann auch mit Cycloalkylgruppen, die gegebenenfalls mit einer oder zwei oder mehreren, Hydroxygruppen substituiert sein können, verethert sein. Die Cycloalkylgruppen können 4-8, insbesondere 6 Kohlenstoffatome besitzen und ggf. an jedem C-Atom eine Hydroxygruppe tragen.
- 40 g) Die 3-OH-Gruppe kann weiterhin mit glycosidisch gebundenen Zuckerresten substituiert sein, beispielsweise Mono-, Di- oder Oligosacchariden mit vorzugsweise 2 oder 3 Zuckerresten. Geeignete Saccharide, insbesondere Monosaccharide, sind Triosen, Tetrosen, Pentosen oder Hexosen, davon insbesondere die Pentosen und Hexosen. Glucose und Fruktose werden besonders bevorzugt. Insbesondere wird Cholestrylglicosid bevorzugt.
- 45 h) Geeignete 3-OH-Derivate sind weiterhin die Ethoxylate, z. B. solche mit Ethylenoxid-Ketten mit einer P/O-Zahl von 1-200, insbesondere 5-150. Bevorzugt werden Choleth-20, Dihydrocholet-30, Laneth-5 bis -50, PEG-50-Lanolin bis PEG-150-Lanolin, PEG-5-Sojasterol bis PEG-50 Sojasterol, PEG-5-Tallölsterolether.
- 50 i) Geeignete 3-OH-Derivate sind weiterhin die Propoxylate, z. B. solche mit einer P/O-Zahl von 1-200, insbesondere 5-30. Bevorzugt werden PPG-5-Lanolin-Wachs, PPG-5-Lanonlin-Alkohol-Ether bis PPG-30-Lanolin-Alkohol-Ether.
- j) Geeignet sind weiterhin die gemischten Ethoxylate-Propoxylate der 3-OH-Gruppe. Geeignete Ethoxylat- oder Propoxylat-Reste können jeweils 1-100, vorzugsweise 10-100 dieser Reste besitzen. Bevorzugte gemischte (E/O)<sub>n</sub>-(P/O)<sub>m</sub>-Ketten mit den vorstehend angegebenen Zahlenwerten für n und m sind PPG-12-PEG-50-Lanolin und PPG-40-PEG-60-Lanolin-Öl.
- 55 k) Bevorzugt, an der 3-OH-Gruppe substituierte Sterole sind auch die Sulfosuccinate. Bevorzugt wird Di-Natrium-Sitostereth-14-Sulfosuccinat.
- l) Weiterhin werden die Umsetzungsprodukte der 3-OH-Gruppe der Sterole, insbesondere des Cholesterols, mit den Aminogruppen von Aminosäuren bevorzugt, wobei z. B. in einer Kondensationsreaktion unter Wasserabspaltung die 3-OH-Gruppe durch den Amino-Rest der Aminosäure ersetzt wird, wodurch die 3-Amino-Derivate des C-3-Atomes des Sterol-Ringsystems gebildet werden. Besonders bevorzugt wird das in dieser Weise erhältliche Amin, das durch Umsetzung von Glutaminsäure mit Cholesterol erhältlich ist.

Besonders bevorzugt werden die vorstehend unter a) bis l) beschriebenen Derivate D des Cholesterols.  
Besonders bevorzugt werden die folgenden erfindungsgemäßen Sterole und Sterolderivate:

60

<u>Substanz</u>	<u>Handelsname</u>	<u>Lieferant/Hersteller</u>
Cholesteryl-Sulfat		
Beta-Sitosterol		
Beta-Sitosterylacetat	Sitostearyl Complex	Variati
Cholecalciferol	Epiderm-Complex O	Cosmetochem
Cholesterol	Cholesterol USP/NF	Croda
Cholesteryl Hydroxystearat	Estemol CHS	beide Nissin
	Salacos HS	Oil Mills
Cholesteryl Isostearat	IS-CE	Kao Corp.
Cholet-20	Nikkol Aquosome EC-5 Nikko	
Cholet-24	Fancol CH-24	Fanning
Dihydrocholesterol		
Dihydrocholesteryl Octyldecanoat	Nikkol DCIS	Nikko
Dihydrocholeth-15	Nikkol DHC-15	Nikko
Dihydrocholeth-20	Nikkol DHC-20	Nikko
Dihydrocholeth-30	Nikkol DHC-30	Nikko
Dihydrolanosterol	Isocholesterol EX	Nikko
Dihydrophytosteryl Octyldecanoat	Nikkol DPIS	Nikko
Disodium Sitostereth-14 Sulfosuccinat	Rewoderm SPS	Rewo Chem.
Ergocalciferol		
Glyceryl Lanolat	Ivarlan 3360	Brooks
	Neocerit	BDF
Laneth-5	Polychol-5	Croda
Laneth-10	Polychol-10	Croda
Laneth-15	Polychol-15	Croda
Laneth-20	Polychol-20	Croda
Laneth-25	Soluan 25	Amerchol
Laneth-50	Sterol LN 50	Auschem
Laneth-10 Acetat	Lipolan 98	Lipo
Lanosterol	Lanosterol	Croda
	Isocholesterol EX	Nikko
PEG-5-Lanolat	Agnosol 5	Croda
PEG-10-Lanolat	Sklirate 10	Croda
PEG-20-Lanolat	Sklirate 20	Croda

<u>Substanz</u>	<u>Handelsname</u>	<u>Lieferant/Hersteller</u>
5 PEG-10-Lanolin	Nikkol TW-10	Nikko
PEG-20-Lanolin	Solan 20	Croda
PEG-30-Lanolin	Nikkol TW-30	Nikko
10 PEG-40-Lanolin	Solan 40	Croda
PEG-75-Lanolin	Aqualose L75	Westbrook Lanolin
15 PEG-100-Lanolin	Aqualose L100	Westbrook Lanolin
PEG-150-Lanolin	Solan X	Croda
PEG-25-Phytosterol		
20 PEG-5-Soya Sterol		
PEG-10-Soya Sterol		
PEG-25-Soya Sterol		
25 PEG-40-Soya Sterol		
PEG-5 Tall Oil Sterol Ether		
30 PPG-2 Lanolin Alcohol Ether	Soluan PB-2	Amerchol
PPG-5-Lanolin Alcohol Ether	Soluan PB-5	Amerchol
PPG-10-Lanolin Alcohol Ether	Soluan PB-10	Amerchol
35 PPG-20-Lanolin Alcohol Ether	Soluan PB-20	Amerchol
PPG-30-Lanolin Alcohol Ether	Soluan PB-30	Amerchol
40 PPG-5-Lanolin Wax	Propoxyol 1695	Henkel
PPG-12-PEG-50 Lanolin	Lanexol AWS	Croda
PPG-12-PEG-65 Lanolin Oil	Fluilan AWS	Croda
45 PPG-40-PEG-60 Lanolin Oil	Aqualose LL 100	Westbrook L.
Soy Sterol		
50 Soy Sterol Acetate		
Tall Oil Sterol		
C10 -C30 Cholesterol/Lanosterol Esters		

55 Die Aufbereitung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe erfolgt nach dem Fachmann geläufigen, üblichen Methoden. Erfindungsgenäße Wirkstoffe sind im Handel erhältlich oder bekannt oder können nach bekannten Verfahren erhalten werden.

60 Die Wirkstoffe sind gegenüber den genannten Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen hervorragend wirksam und zur Behandlung der genannten Krankheiten und Zustände geeignet.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe wirken insbesondere im Sinne von desinfizierenden Wirkstoffen, z. B. einer die Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen abtötenden Wirkung oder z. B. in einer Wachstumshemmung für diese. Diese Wirkprinzipien werden insbesondere auch mit den Begriffen antimikrobielle, antivirale, antiparasitäre und gegenüber Protozoen antiparasitäre Wirkung gegenüber Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen bezeichnet und sollen in gleicher Weise auch für diese Wirkstoffe gelten.

65 Es hat sich in erstaunlicher Weise herausgestellt, daß die erfindungsgemäßen Wirkstoffe das Wachstum von grampositiven und grammnegativen Bakterien, Mycobionten, Protozoen, Parasiten sowie Viren verhindern. Dabei wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in synergistischer Weise, also überadditiv in bezug auf die Einzelkomponenten.

Insbesondere sind die erfundungsgemäßen Wirkstoffe befähigt, das Wachstum von Hefen, insbesondere der Pityrosporum-Arten, namentlich Pityrosporum ovale, zu verhindern.

Es hat sich ferner herausgestellt, daß die erfundungsgemäßen Wirkstoffe die Bildung von seborrhoischen Erscheinungen, insbesondere Kopfschuppen, verhindern sowie bereits vorhandene seborrhoische Erscheinungen, insbesondere Kopfschuppen, beseitigen.

Die erfundungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich darüberhinaus gut für die Verwendung als desodorierender Wirkstoff in kosmetischen Desodorantien sowie gegen unreine Haut, leichte Formen der Akne bzw. Propionibakterium acnes.

Schließlich hat sich herausgestellt, daß die erfundungsgemäßen Wirkstoffe den Verderb organischer Substanz, insbesondere kosmetischer und dermatologischer Zubereitungen, durch den Befall mit grampositiven und gramnegativen Bakterien, Mycobionten, Protozoen, Parasiten und Viren verhindern können, wenn sie diesen Zubereitungen zugesezt werden.

Erfundungsgemäß sind somit auch ein Verfahren zur Bekämpfung von Mycobionten, dadurch gekennzeichnet, daß die erfundungsgemäßen Wirkstoffe gegebenenfalls in einem geeigneten kosmetischen oder dermatologischen Träger, mit dem durch Mycobionten kontaminierten Bereich in Kontakt gebracht werden, sowie ein Verfahren zum Schutze organischer Produkte vor dem Befall mit Mycobionten, dadurch gekennzeichnet, daß diesen organischen Produkten die erfundungsgemäßen Wirkstoffe in wirksamer Menge zugegeben werden.

Der Stand der Technik lieferte folglich nicht den geringsten Hinweis auf die erfundungsgemäße Verwendung als antimycotisches Wirkprinzip.

Ferner war erstaunlich, daß die erfundungsgemäßen Wirkstoffe besonders gut wirksam sind gegen den für das Entstehen von Kopfschuppen verantwortlichen Keim Pityrosporum ovale und verwandte Keime. Eine bevorzugte Ausführungsförm der vorliegenden Erfindung sind mithin gegen Kopfschuppen anzuwendende Formulierungen, beispielsweise Anti-Schuppen-Schampoos.

Erfundungsgemäß werden die Wirkstoffe bevorzugt in kosmetischen oder dermatologischen Zusammensetzungen eingesetzt, mit einem Gehalt von 0,1-50 Gew.-%, insbesondere 5-35 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung. Vorteilhaft enthalten die Zusammensetzungen 10, insbesondere 10,1,-25 Gew.-% an den erfundungsgemäßen Wirkstoffen.

Die Anwendung der Wirkstoffe kann topisch, perkutan, transdermal, parenteral, oral oder auch intravasal erfolgen. Zubereitungen, die erfundungsgemäße Wirkstoffe enthalten, können topische Zubereitungen sein, beispielsweise kosmetische und dermatologische topische Zubereitungen oder aber auch übliche Arzneimittel-Darreichungsformen. Bevorzugt werden Desodorantien oder desodorierende Körperreinigungsprodukte oder Körperpflegeprodukte. Die Wirkstoffe können aber auch in Desinfektionsmitteln und/oder Reinigungsmitteln enthalten sein, die nicht nur zur Behandlung des Körpers oder der Haut bestimmt sind, sondern auch zum Reinigen und Desinfizieren von harten Oberflächen, medizinischen Materialien, Geräten, Instrumenten, Mobiliar und Wänden.

Für den Körper bestimmte Reinigungsmittel, Desinfektionsmittel und Spülmittel können ebenfalls zur Behandlung der Haut verwendet werden, wie schon die topischen Zubereitungen. Sie dienen aber vorzugsweise zur Behandlung von Körperhöhlen, Wunden und auch des Mund- und Rachenraumes sowie der Nase.

Die erfundungsgemäßen Wirkstoffe lassen sich ohne Schwierigkeiten in gängige kosmetische oder dermatologische Formulierungen einarbeiten, vorteilhaft in Pumpsprays, Aerosolsprays, Crèmes, Salben, Tinkturen, Lotionen, Nagelpflegeprodukte (z. B. Nagellacke, Nagellackentferner, Nagelbalsame) und dergleichen.

Es ist auch möglich und gegebenenfalls vorteilhaft, die erfundungsgemäßen Wirkstoffe mit anderen Wirkstoffen zu kombinieren, beispielsweise mit anderen antimikrobiell, antimycotisch bzw. antiviral wirksamen Stoffen.

Es ist vorteilhaft, die erfundungsgemäßen Zusammensetzungen abzupuffern. Vorteilhaft ist ein pH-Bereich von 3,5-7,5. Besonders günstig ist es, den pH-Wert in einem Bereich von 4,0-6,5 zu wählen.

Die erfundungsgemäßen kosmetischen und/oder dermatologischen Formulierungen können wie üblich zusammengesetzt sein und zur Behandlung der Haut und/oder der Haare im Sinne einer dermatologischen Behandlung oder einer Behandlung im Sinne der pflegenden Kosmetik dienen. Sie können aber auch in Schminkeprodukten in der dekorativen Kosmetik eingesetzt werden.

Zur Anwendung werden die erfundungsgemäßen kosmetischen und/oder dermatologischen Formulierungen in der für Kosmetika und Dermatika üblichen Weise auf die Haut und/oder die Haare in ausreichender Menge aufgebracht.

Vorteilhaft sind solche kosmetische und dermatologische Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen. Vorteilhaft enthalten diese zusätzlich mindestens einen UVA-Filter und/oder mindestens einen UVB-Filter und/oder mindestens ein anorganisches Pigment.

Kosmetische Zubereitungen gemäß der Erfindung zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen können in verschiedenen Formen vorliegen, wie sie z. B. üblicherweise für diesen Typ von Zubereitungen eingesetzt werden. So können sie z. B. eine Lösung, eine Emulsion vom Typ Wasser-in-Öl (W/O) oder vom Typ Öl-in-Wasser (O/W), oder eine multiple Emulsionen, beispielsweise vom Typ Wasser-in-Öl-in-Wasser(W/O/W), ein Gel, eine Hydrodispersion, einen festen Stift oder auch ein Aerosol darstellen.

Die erfundungsgemäßen kosmetischen Zubereitungen können kosmetische Hilfsstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z. B. Konservierungsmittel, Bakterizide, Antioxidantien, Parfüme, Mittel zum Verhindern des Schämens, Farbstoffe, Pigmente, die eine färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Emulgatoren, weichmachende Substanzen, anfeuchtende und/oder feuchthalrende Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel oder Silikonderivate.

Sofern die kosmetische oder dermatologische Zubereitung eine Lösung oder Lotion darstellt, können als Lösungsmittel verwendet werden:

- Wasser oder wässrige Lösungen,
- Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl,

- Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z. B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fetalkoholen mit Alkanosäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren.
  - Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomonoethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomonoethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte.

Insbesondere werden Gemische der vorstehend genannten Lösungsmittel verwendet. Bei alkoholischen Lösungsmitteln kann Wasser ein weiterer Bestandteil sein.

Erfahrungsgemäß können als günstige Antioxidantien alle für kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen geeigneten oder gebräuchlichen Antioxidantien verwendet werden.

Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z. B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Iminazole (z. B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z. B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z. B.  $\alpha$ -Carotin,  $\beta$ -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z. B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z. B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystanin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-,  $\gamma$ -Linoleyl-, Cholesteryl – und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z. B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z. B. pmol bis  $\mu$ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z. B.  $\alpha$ -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin),  $\alpha$ -Hydroxysäuren (z. B. Zitronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z. B.  $\gamma$ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z. B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z. B. Vitamin E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin A-palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoearharzes, Rutinsäure und deren Derivate, Ferulasäure und deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaresäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z. B. ZnO, ZnSO<sub>4</sub>) Selen und dessen Derivate (z. B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z. B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfundungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05– 20 Gew.-%, insbesondere 1–10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001– 10,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Sofern Vitamin A, bzw. Vitamin-A-Derivate, bzw. Carotin bzw. deren Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001–10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Erfahrungsgemäße Emulsionen sind vorteilhaft und enthalten z. B. die genannten Fette, Öle, Wachse und anderen Fettkörper, sowie Wasser und einen Emulgator, wie er üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet wird.

Gele gemäß der Erfindung enthalten üblicherweise Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin und Wasser bzw. ein vorstehend genanntes Öl in Gegenwart eines Verdickungsmittels, das bei ölig-alkoholischen Gelen vorzugsweise Siliciumdioxid oder ein Aluminiumsilikat, bei wäßrigalkoholischen oder alkoholischen Gelen vorzugsweise ein Polvacrylat ist.

Feste Stifte gemäß der Erfindung enthalten z. B. natürliche oder synthetische Wachse, Fettalkohole oder Fettsäureester. Bevorzugt werden Lippenpflegestifte sowie desodorierende Stifte ("Deo-Stifte").

Als Treibmittel für erfundungsgemäße, aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische oder dermatologische Zubereitungen sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, z. B. Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die vorliegende Erfindung geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenklicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorkohlenwasserstoffe und Fluorchlorkohlenwasserstoffe (FC'KW).

Bevorzugt können die erfindungsgemäßen Zubereitungen zudem Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z. B. 0.1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0.5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1 bis 6 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel dienen.

Die UVB-Filter können ölföslich oder wasserlöslich sein. Als ölfösliche Substanzen sind z. B. zu nennen:

- 3-Benzylidencampher und dessen Derivate, z. B. 3-(4-Methylbenzyliden)-campher.
  - 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester;
  - Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
  - Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Sal-

cylsäurehomionentheylester:

- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- Ester der Benzalualonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalualonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;
- 2,4,6-Trianilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin.

5

Als wasserlösliche Substanzen sind vorteilhaft:

- 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure und deren Salze, z. B. Natrium-, Kalium- oder Triethanolaminium-Salze.
- Sulfonsäure-Derivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z. B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und ihre Salze.

10

15

20

25

30

35

40

45

55

60

65

Die Liste der genannten UVB-Filter, die erfindungsgemäß Verwendung finden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

Es kann auch von Vorteil sein, in erfindungsgemäßen Zubereitungen UVA-Filter einzusetzen, die üblicherweise in kosmetischen und/oder dermatologischen Zubereitungen enthalten sind. Bei solchen Substanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-tert.Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion. Auch Zubereitungen, die diese Kombinationen enthalten, sind Gegenstand der Erfindung. Es können die gleichen Mengen an UVA-Filtersubstanzen verwendet werden, welche für UVB-Filtersubstanzen genannt wurden.

Erfindungsgemäße kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen können auch anorganische Pigmente enthalten, die üblicherweise in der Kosmetik zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen verwendet werden. Dabei handelt es sich um Oxide des Titans, Zinks, Eisens, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Aluminiums, Cers und Mischungen davon, sowie Abwandlungen, bei denen die Oxide die aktiven Agentien sind. Besonders bevorzugt handelt es sich um Pigmente auf der Basis von Titandioxid. Es können die für die vorstehenden Kombinationen genannten Mengen verwendet werden.

Bei kosmetischen Zubereitungen zur Pflege der Haare handelt es sich beispielsweise um Shampooierungsmittel, Zubereitungen, die beim Spülen der Haare vor oder nach der Shampooierung, vor oder nach der Dauerwellbehandlung, vor oder nach der Färbung oder Entfärbung der Haare angewendet werden, um Zubereitungen zum Fönen oder Einlegen der Haare, Zubereitungen zum Färben oder Entfärben, um eine Frisier- und Behandlungslotion, einen Haarlack oder um Dauerwellmittel.

Die kosmetischen Zubereitungen enthalten Wirkstoffe und Hilfsstoffe, wie sie üblicherweise für diesen Typ von Zubereitungen zur Haarpflege und Haarbehandlung verwendet werden.

Als Hilfsstoffe dienen Konservierungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Substanzen zum Verhindern des Schämens, Emulgatoren, Verdickungsmittel, Fette, Öle, Wachse, organische Lösungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Farbstoffe oder Pigmente, deren Aufgabe es ist, die Haare oder die Zubereitung selbst zu färben, Elektrolyte, Zubereitungen gegen das Fetteln der Haare.

Kosmetische Zubereitungen, die ein Shampooierungsmittel oder eine Wasch-, Dusch- oder Badezubereitung darstellen, enthalten vorzugsweise mindestens eine anionische, nicht-ionische oder amphotere oberflächenaktive Substanz oder Gemische daraus, erfindungsgemäße Wirkstoffe und Hilfsmittel, wie sie üblicherweise dafür verwendet werden.

Beispiele für oberflächen aktive Substanzen, die erfindungsgemäß vorteilhaft verwendet werden können, sind herkömmliche Seifen, z. B. Fettsäuresalze des Natriums, Alkylsulfate, Alkylethersulfate, Alkan- und Alkylbenzolsulfonate, Sulfoacetate, Sulfobetaine, Sarcosinate, Amidosulfobetaine, Sulfosuccinate, Sulfobensteinsäurehalbester, Alkylethercarboxylate, Eiweiß-Fettsäure-Kondensate, Alkylbetaine und Amidobetaine, Fettsäurealkanolamide, Polyglycoether-Derivate.

Die oberflächenaktive Substanz kann in einer Konzentration zwischen 1 Gew.-% und 50 Gew.-% in dem Shampooierungsmittel, bzw. der Wasch-, Dusch- oder Badezubereitung, vorliegen.

Liegt die kosmetische oder dermatologische Zubereitung in Form einer Lotion vor, die ausgespült und z. B. vor oder nach der Entfärbung, vor oder nach der Shampooierung, zwischen zwei Shampooierungsschritten, vor oder nach der Dauerwellbehandlung angewendet wird, so handelt es sich dabei z. B. um wäßrige oder wäßrig-alkoholische Lösungen, die gegebenenfalls oberflächenaktive Substanzen enthalten, bevorzugt nicht-ionische oder kationische oberflächenaktive Substanzen, deren Konzentration zwischen 0,1 und 10 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,2 und 5 Gew.-%, liegen kann. Diese kosmetische oder dermatologische Zubereitung kann auch ein Aerosol mit den üblicherweise dafür verwendeten Hilfsmitteln darstellen.

Eine kosmetische Zubereitung in Form einer Lotion, die nicht ausgespült wird, insbesondere eine Lotion zum Einlegen der Haare, eine Lotion, die beim Fönen der Haare verwendet wird, eine Frisier- und Behandlungslotion, stellt im allgemeinen eine wäßrige, alkoholische oder wäßrig-alkoholische Lösung dar und enthält mindestens ein kationisches, anionisches, nicht-ionisches oder amphoteres Polymer oder auch Gemische davon, sowie erfindungsgemäße Wirkstoffe. Die Menge der verwendeten erfindungsgemäßen Wirkstoffe liegt z. B. zwischen 0,1 und 10 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,1 und 3 Gew.-%.

Kosmetische und dermatologische Zubereitungen zur Behandlung und Pflege der Haare, die die erfindungsgemäßen Wirkstoffe enthalten, können als Emulsionen vorliegen, die vom nicht-ionischen oder anionischen Typ sind. Nicht-ionische Emulsionen enthalten neben Wasser Öle oder Fettalkohole, die beispielsweise polyethoxyliert oder polypropoxyliert sein können, oder auch Gemische aus den beiden organischen Komponenten. Diese Emulsionen enthalten gegebenenfalls kationische oberflächenaktive Substanzen. Anionische Emulsionen sind vorzugsweise vom Typ einer Seife und enthalten mindestens eine erfindungsgemäße ethoxylierte oder propoxylierte organische Verbindung mit anionischem oder nicht-ionischem Charakter.

# DE 196 43 586 A

Kosmetische und dermatologische Zubereitungen zur Behandlung und Pflege der Haare können als Gele vorliegen, die neben erfundungsgemäßen Wirkstoffen und dafür üblicherweise verwendeten Lösungsmitteln noch organische Verdickungsmittel, z. B. Gummiarabikum, Xanthangummi, Natriumalginat, Cellulose-Derivate, vorzugsweise Methylcellulose, Hydroxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose oder anorganische Verdickungsmittel, z. B. Aluminiumsilikate wie beispielsweise Bentonite, oder ein Gemisch aus Polyethylenglykol und Polyethylenglykolstearat oder -distearat, enthalten. Das Verdickungsmittel ist im Gel z. B. in einer Menge zwischen 0,1 und 30 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,5 und 15 Gew.-%, enthalten.

Vorzugweise beträgt die Menge der erfundungsgemäßen Wirkstoffe in einem für die Haare bestimmten Mittel 0,01 Gew.-% bis 10 Gew.-%, insbesondere 0,5 Gew.-% bis 5 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Soweit nicht anders angegeben, beziehen sich Mengenangaben, Prozentangaben und Teile auf das Gewicht, insbesondere auf das Gesamtgewicht der jeweiligen Mischung oder Zubereitung.

Die folgenden Beispiele sollen die Verkörperungen der vorliegenden Erfindungen verdeutlichen. Die Angaben beziehen sich stets auf Gewichts-%, sofern nicht andere Angaben gemacht werden.

Die folgenden Beispiele sollen die Verkörperungen der vorliegenden Erfindungen verdeutlichen. Die angegebenen Zahlenwerte sind Gew.-%.

## Beispiel 1

### W/O-Crème

	Paraffinöl	10,00
	Ozokerit	4,00
	Vaseline	4,00
25	pflanzliches Öl	10,00
	Wollwachsalkohol	2,00
	Aluminiumstearat	0,40
	Dihydrocholesteryl-octyldecanoat	12,00
30	Parfum, Konservierungsstoffe	q. s.
	Wasser, VES	ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge Glyceryllanolat, Cholesteryl-isostearat oder Laneth-10 anstelle von Dihydrocholesteryl-octyldecanoat formuliert werden.

## Beispiel 2

### W/O-Lotion

	Paraffinöl	25,00
40	Siliconöl	2,00
	Ceresin	1,50
	Wollwachsalkohol	0,50
	Glucosesesquiisostearat	2,50
45	Dihydrocholesteryl-octyldecanoat	15,00
	Parfum, Konservierungsstoffe	q. s.
	Wasser, VES	ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge Dihydrocholesterol, Cholesterin oder Cholecalciferol anstelle von Dihydrophytosteryl-octyldecanoat formuliert werden.

## Beispiel 3

### O/W-Lotion

	Paraffinöl	5,00
	Isopropylpalmitat	5,00
	Cetylalkohol	2,00
	Bienenwachs	2,00
	Ceteareth-20	2,00
60	PEG-20-Glycerylstearat	1,50
	Glycerin	3,00
	Lanosterol	12,00
	Parfum, Konservierungsstoffe	q.s.
	Wasser, VES	ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Mengen PPG-5-Lanolin Wax, PEG-25-Phytosterol oder PEG-40 Soya Sterol anstelle von PEG-20-Glycerylstearat formuliert werden.

#### Beispiel 4

##### O/W-Crème

Pflanzliches Öl	10.00	5
Cetylalkohol	2.00	
Glycerinmonostearat	1.50	
PEG-30-Glycerylstearat	2.00	
Glycerin	3.00	
Isopropylpalmitat	3.00	
Carbopol 980 (neutralisiert)	5.00	10
PPG-10-Lanolin Alcohol Ether	0.30	
Parfum, Konservierungsstoffe	5.00	
Wasser, VES	q.s.	
	ad 100.00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an PEG-10 Lanolin, PEG-20 Soya Sterol oder Tall Oil Sterol anstelle von PPG-10-Lanolin Alcohol Ether formuliert werden.

#### Beispiel 5

##### Salbe

Vaseline	36.00	
Ceresin	10.00	
Zinkoxid	4.00	
Pflanzliches Öl	20.00	25
Wollwachsalkohol	10.00	
Parfum, Konservierungsstoffe	q.s.	
Paraffinöl	ad 100.00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Lanosterol, PEG-25-Phytosterol oder Cholestryloleat anstelle von Wollwachsalkohol formuliert werden.

#### Beispiel 6

##### Hautöl

Cetylpalmitat	3.00	
C <sub>12-15</sub> -Alkylbenzoat	2.00	
Polyisobuten	10.00	
Squalan	2.00	40
β-Sitosterol	15.00	
Parfum, Konservierungsstoffe	q.s.	
Paraffinöl	ad 100.00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Dihydrocholesterol, Disodium Sitostereth-14-sulfosuccinat oder PEG-10-Soya Sterol anstelle von β-Sitosterol formuliert werden.

#### Beispiel 7

##### Badeöl

Paraffinöl	20.00	
PEG-40-hydriertes Rizinusöl	5.00	
Cholesteryl-Hydroxystearat	11.00	
Parfum, Konservierungsstoffe	q.s.	
Sojaöl	ad 100.00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Laneth-20, PPG-5 Lanolin Wax oder PEG-25 Phytosterol anstelle von Cholesteryl-Hydroxystearat formuliert werden.

## Beispiel 8

## Lippenstift

5	Ceresin		8,00
	Bienenwachs		4,00
	Carnaubawachs		2,00
	Vaseline		40,00
10	Hydriertes Rizinusöl		4,00
	Cholesterol		7,50
	Parfum, Konservierungsstoffe		q.s.
	Paraffinöl		ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Cholestryloleat, Lanosterol oder Soya Sterol anstelle von Cholesterol formuliert werden.

## Beispiel 9

## Pflegemaske

20	PEG-50 Lanolin		0,50
	Glycerylstearat		2,00
	Sonnenblumenkernöl		3,00
	Bentonit		8,00
25	Kaolin		35,00
	Zinoxid		5,00
	PEG-5-Phytosterol		5,00
	Parfum, Konservierungsstoffe		q.s.
30	Wasser, VES		ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an PEG-5-Lanolat, PPG-5-Lanolin Wax oder Soya Sterole Acetate anstelle von PEG-5-Phytosterol formuliert werden.

## Beispiel 10

## Liposomenhaltiges Gel

35	Lecithin		6,00
	Pflanzliches Öl		12,50
40	Hydrolysiertes Kollagen		2,00
	Xanthan Gum		1,40
	Butylenglycol		3,00
	Lanosterol		10,00
45	Parfum, Konservierungsstoffe		q.s.
	Wasser, VES		ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Wollwachsalkohol, Cholestryl Isostearat oder Glyceryl-lanolat anstelle von Lanosterol formuliert werden.

## Beispiel 11

## Duschpräparat mit Rückfetter

55	Cocoamidodiacetat		10,00
	Natriumlaurylsulfat		2500
	Kalium Cocyl Hydrolysiertes Kollagen		5,00
	Macadamianußöl		5,00
	Natriumchlorid		0,60
60	Disodium Sitostereth-14-Sulfosuccinat		20,00
	Parfum, Konservierungsstoffe		q.s.
	Wasser, VES		ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an PPG-12-PEG-50-Lanolin, Cholestryl Hydroxystearat oder Dihydrocholeth-15 anstelle von Disodium Sitostereth-14-Sulfosuccinat formuliert werden.

### Beispiel 12

#### Seifenstück

Na-Salz aus Talgfettsäuren	60,00	5
Na-Salz aus Kokosöl	28,00	
Natriumchlorid	0,50	
Wollwachsalkohol	10,00	
Parfum, Konservierungsstoffe	q.s.	
Wasser, VES	ad 100,00	10

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Glyceryllanolat, Lanosterol oder Soya Sterol anstelle von Wollwachsalkohol formuliert werden.

### Beispiel 13

#### Syndetseife

Natriumlaurylsulfat	30,00	
Natriumsulfosuccinat	10,00	20
Kaliumcocooyl hydrolysiertes Kollagen	2,00	
Dimethicon Copolyol	2,00	
Paraffin	2,00	
Maisstärke	10,00	
Talcum	10,00	25
Glycerin	3,00	
Wollwachsalkohol	15,00	
Parfum, Konservierungsstoffe	q. s.	
Wasser, VES	ad 100,00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Glyceryllanolat, Lanosterol oder Soya Sterol anstelle von Wollwachsalkohol formuliert werden.

### Beispiel 14

#### Haarpflegemittel

TEA-Cocoyl hydrolysiertes Kollagen	30,00	
Monoethanolaminlaurylsulfat	25,00	
Mandelöl	2,00	40
Natriumchlorid	1,00	
Cholecalciferol	7,50	
Parfum, Konservierungsstoffe	q. s.	
Wasser, VES	ad 100,00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an  $\beta$ -Sitosterol, Cholesterol oder Stearyl Glycyrrhetinat anstelle von Cholecalciferol formuliert werden.

### Beispiel 15

#### Pflegeshampoo

Dinatriumlaurylsulfosuccinat	6,00	
Cocoamidopropylbetaín	10,00	
Glycoldistearat	5,00	55
7-Dehydrocholesterol	12,00	
Parfum, Konservierungsstoffe	q. s.	
Wasser, VES	ad 100,00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Lanosterol, Glyceryllanolat oder Stearyl Glycyrrhetinat anstelle von 7-Dehydrocholesterol formuliert werden.

## Beispiel 16

## Haarkur

5	Cetylalkohol		5,00
10	Caprylic/Capric Triglyceride		3,00
15	Petrolatum		3,00
	Wollwachsalkohol		2,00
	Glyceryllanolat		0,50
10	Parfum, Konservierungsstoffe		12,50
	Wasser, VES		q. s.
			ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Cholesteryl Iso-stearat, Cholesteryloleat oder Dihydrolanosterol anstelle von Glyceryllanolat formuliert werden.

## Beispiel 17

## Haarspülung

20	Cocoamidopropylbetain		5,00
	Cetylalkohol		2,00
	Propylenglycol		2,00
	Citronensäure		0,30
25	Glyceryllanolat		10,00
	Parfum, Konservierungsstoffe		q. s.
	Wasser, VES		ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Soya Sterol, Cholesterylhydroxystearat oder Laneth-10 anstelle von Glyceryllanolat formuliert werden.

## Beispiel 18

## Haarfestiger

35	Polyvinylpyrrolidon/Vinylacetat/Vinylpropionat-Copolymer		5,00
	Ethanol		45,00
	$\beta$ -Sitosterol		7,50
	Parfum, Konservierungsstoffe		q. s.
40	Wasser, VES		ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Ergocalciferol, Laneth-15 oder PPG-5-Lanolin Wax anstelle von  $\beta$ -Sitosterol formuliert werden.

## Beispiel 19

## Frisiercrème

45	Vaseline		4,00
50	Cetearylalkohol		4,00
	PEG-40-hydriertes Rizinusöl		2,00
	Isopropylpalmitat		5,00
	Citronensäure		1,00
	7-Dehydrocholesterol		5,00
55	Parfum, Konservierungsstoffe		q. s.
	Wasser, VES		ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Cholesterin, Wollwachsalkohol oder Soya Sterol anstelle von 7-Dehydrocholesterol formuliert werden.

### Beispiel 20)

#### Rasierschaum

Stearinsäure	7,00	5
Natriumlaurylsulfat	3,00	
Stearylalkohol	1,00	
Glycerin	5,00	
Triethanolamin	3,60	
Soya Sterol	5,00	10
Parfum, Konservierungsstoffe	q. s.	
Wasser, VES	ad 100,00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Cholesterin, Wollwachsalkohol oder Glyceryllanolat anstelle von Soya Sterol formuliert werden.

15

### Beispiel 21)

#### Fußcrème

Solan 5	2,00	20
Methylsalicylat	5,00	
Caprylic/Capric Triglyceride	10,00	
Stearinsäure	5,00	
Cetylalkohol	1,00	
Glycerin	2,00	25
Dimethicon	1,00	
Carbopol 984	0,50	
Triethanolamin	1,50	
Wollwachsalkohol	12,50	
Parfum, Konservierungsstoffe	q. s.	30
Wasser, VES	ad 100,00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Dihydrocholesterol, Dihydrolanosterol oder Soya Sterol anstelle von Wollwachsalkohol formuliert werden.

35

### Beispiel 22)

#### Aerosolspray

Octyldodecanol	0,50	40
7-Dehydrocholesterol	5,00	
Parfum, Konservierungsstoffe	q. s.	
Ethanol	ad 100,00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Wollwachsalkohol, Glyceryllanolat oder Soya Sterol anstelle von 7-Dehydrocholesterol formuliert werden.

45

Die durch Zusammenmischung der jeweiligen Bestandteile erhaltene flüssige Phase wird zusammen mit einem Propan-Butan-Gemisch (2 : 7) im Verhältnis 39 : 61 in Aerosolbehälter abgefüllt.

50

### Beispiel 23)

#### Pumpspray

PEG-40-Hydriertes Rizinusöl	2,00	55
Glycerin	1,00	
Dihydrophytosteryl Octyldecanoat	10,00	
Parfum, Konservierungsstoffe	q. s.	
Wasser, VES	ad 100,00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an 7-Dehydrocholesterol, Cholestryloleat oder Cholestryl Isostearat anstelle von Dihydrophytosteryl Octyldecanoat formuliert werden.

60

65

## DE 196 43 586 A

## Beispiel 24

## Roll-on-Gel

5	1,3-Butylenglycol		2,00
	PEG-40-Hydriertes Rizinusöl		2,00
	Hydroxyethylcellulose		0,50
	Dihydrolanosterol		10,00
10	Parfum, Konservierungsstoffe		q. s.
	Wasser, VES		ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Glyceryllanolat, Soya Sterol oder Dihydrocholeth-20 anstelle von Dihydrolanosterol formuliert werden.

## Beispiel 25

## Roll-on-Emulsion

20	Tricetearethphosphat		0,30
	Octyldodecanol		2,00
	C <sub>12-15</sub> -Alkylbenzoat		2,00
	C <sub>10-30</sub> -Alkylacrylat		0,15
	Dihydrocholeth-20		12,00
25	Parfum, Konservierungsstoffe		q. s.
	Wasser, VES		ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Laneth-15, PPG-40-PEG-60-Lanolin Oil oder Tall Oil Sterol anstelle von Dihydrocholeth-20 formuliert werden.

## Beispiel 26

## Wachsstift

35	Hydriertes Rizinusöl		5,00
	Bienenwachs		6,00
	Ceresin		30,00
	C <sub>12-15</sub> -Alkylbenzoat		17,00
	Wollwachsalkohol		20,00
40	Parfum, Konservierungsstoffe		q. s.
	Octyldodecanol		ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an β-Sitosterol, Cholesterol oder Glyceryllanolat anstelle von Wollwachsalkohol formuliert werden.

## Beispiel 27

## Herstellung von Kapseln

Kapseln, welche die nachstehend angegebenen Bestandteile enthalten, werden nach bekannten Arbeitsweisen hergestellt. Diese sind für die Behandlung der vorstehenden Zwecke in Dosierungsmengen von jeweils einer Kapsel einmal oder mehrmals täglich geeignet:

55 Cholecalciferol 0,50 g; oder  
Ergocalciferol 0,50 g.

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Soya Sterol, β-Sitosterol oder Glycyrrheicinsäure anstelle von Cholecalciferol oder Ergocalciferol formuliert werden.  
Die Zahlenangaben in den vorstehenden Beispielen sind Gew.-%.

## Beispiel 28

## Aerosolspray

65	Octyldodecanol		0,50
	7-Dehydrocholesterol		5,00
	Parfum, Konservierungsstoffe		q. s.
	Ethanol		ad 100,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Soya Sterol, Cholestryloleat oder Cholesterylpalmitoleat anstelle von 7-Dehydrocholesterol formuliert werden.

Die durch Zusammensetzung der jeweiligen Bestandteile erhaltene flüssige Phase wird zusammen mit einem Propan-Butan-Gemisch (2 : 7) im Verhältnis 39 : 61 in Aerosolbehälter abgefüllt.

Beispiel 29

Pumpsspray

PEG-40-Hydriertes Rizinusöl	2.00	10
Glycerin	1.00	
Glyceryllanolat	7.50	
Parfum, Konservierungsstoffe	q. s.	
Wasser, VES	ad 100.00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an PEG-25 Soya Sterol, Dihydrolanosterol oder Wollwachsalkohol anstelle von Glyceryllanolat formuliert werden.

Die Zahlenangaben in den Beispielen sind Gewichtsprozente.

Die erfundungsgemäßen Wirkstoffe können besonders vorteilhaft in Mikroemulsionen verwendet werden. Kosmetische und dermatologische Zubereitungen gemäß der Erfindung können besonders vorteilhaft als

- a) unverdickte,
- b) klassisch, z. B. durch Zusatz von Polyoxameren, Pluronics, Carragenanen oder Pflanzengummien verdickte,
- c) durch Zusatz von A-B-A-Triblockcopolymeren (z. B. PEG-150-Distearat, Fa. Akzo Nobel) oder alpha, omega-bis-polyethoxylierte Silane oder Silikone) verdickte,
- d) durch Zusatz von Sternpolymeren (z. B. PEG-300-Pentaerythrityl-tetrastearat oder hydrophob modifizierte Tetraakis-polyethoxylierte Silane und Silikone) verdickte,
- e) durch Zusatz von A-B-A-B-Multiblock-Copolymeren, Starburst-Polymeren, Dendrimeren und anderen supramolekularen Vernetzern (z. B. Rheodol TWIS 399, Fa. KAO, oder PEG-120-Methylglucose-dioleat) verdickte Öl-in-Wasser- (O/W-), bikontinuierliche oder Wasser-in-Öl-(W/O-)Mikroemulsionen Verwendung finden.

Beispiel 30

1,3-Di-(2-ethylhexyl)-cyclohexan	35.00	35
Glyceryllanolat	10.00	
Sorbitanmonolaurat	10.00	
Wasser (+Zitronensäure bis pH 5.5)	45.00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Dihydrolanosterol, Dihydrophytosteryl Octyldecanoat oder Cholestryloleat anstelle von Glyceryllanolat formuliert werden.

Beispiel 31

1,3-Di-(2-ethylhexyl)-cyclohexan	33.00	45
Laneth-10-Aacetat	10.00	
Sorbitanmonolaurat	10.00	
Wasser (+Zitronensäure bis pH 5.5)	45.00	
PEG-150-Distearat	2.00	

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Choeth-20, Laneth-5 oder PPG-10-Lanolin Alcohol Ether anstelle von Sorbitanmonolaurat formuliert werden.

Beispiel 32

Steareth-15	4.80	55
Glycerin-monostearat	2.40	
Glyceryllanolat	7.50	
Cyclomethicon	3.30	
Cetearylcoctanoat	1.70	
Wasser	85.30	60

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an Cholestryl Iso-stearat, Glycyrrhetinyl Stearat oder Soya Sterol Acetate anstelle von Glyceryllanolat formuliert werden.

## Beispiel 33

5	Steareth-15	4,80
	Glycerin-monostearat	2,40
	Cholesteryl Hydroxystearat	2,40
	Cyclomethicon	7,50
	Cetearyl Octanipat	3,30
10	Wasser	17,00
	PEG-150-Distearat	83,30
		2,00

Das o.g. Beispiel kann auch mit einer identischen Menge an  $\beta$ -Sitosteryl Acetat, Cholesteryl Oleat oder Dihydrophytosteryl Octyldecanoat anstelle von Cholesteryl Hydroxystearat formuliert werden.

## 15 Patentansprüche

1. Verwendung einer Verbindung oder mehrerer Verbindungen aus der Gruppe der Sterole und Sterolderivate als antimikrobielle, antivirale, antiparasitäre und gegenüber Protozoen antiparasitäre Wirkstoffe gegenüber Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen.
2. Verwendung einer Verbindung oder mehrerer Verbindungen aus der Gruppe der Sterole und Sterolderivate als antimikrobielle, antivirale, antiparasitäre und gegenüber Protozoen antiparasitäre Wirkstoffe gegenüber Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen als Bestandteil von Zubereitungen.
3. Zubereitungen mit einem Gehalt von einer Verbindung oder mehreren Verbindungen aus der Gruppe der Sterole und Sterolderivate mit antimikrobieller, antiviraler, antiparasitärer und gegenüber Protozoen antiparasitärer Wirkung gegenüber Mikroorganismen, Viren, Parasiten und Protozoen.
4. Verwendungen oder Zubereitungen gemäß Anspruch 1-3, dadurch gekennzeichnet, daß die Sterole und Sterolderivate gewählt werden aus der Gruppe Cholesterin, 7-Dehydrocholesterol, Dihydrocholesterol, Lanosterol, Dihydrolanosterol, Spongosterol, Koprosterol, Phytosterole, Cholestryloleat und Cholesterylsulfat.
5. Zubereitungen gemäß Anspruch 1-4, dadurch gekennzeichnet, daß es sich um topische Zubereitungen handelt.
6. Verwendung der Wirkstoffe gemäß Anspruch 1-4 als Wirkstoffe in Desodorantien.

35

40

45

50

55

60

65